# QUINAZOLINE DERIVATIVES AS ANGIOGENESIS INHIBITORS

Publication number: WO0047212

**Publication date:** 

2000-08-17

Inventor:

HENNEQUIN LAURENT FRANCOIS AND (FR); PLE

PATRICK (FR); STOKES ELAINE SOPHIE ELIZABETH

(GB); MCKERRECHER DARREN (GB)

Applicant:

ASTRAZENECA UK LTD (GB); ZENECA PHARMA SA (FR); HENNEQUIN LAURENT FRANCOIS AND (FR); PLE PATRICK (FR); STOKES ELAINE SOPHIE ELIZABETH (GB); MCKERRECHER DARREN (GB)

Classification:

- international:

A61K31/517; C07D239/88; C07D239/94; C07D401/12; C07D401/14; C07D403/12; C07D403/14; C07D405/12; C07D405/14; C07D413/14; C07D417/12; C07D417/14; C07D471/04; C07D521/00; A61K31/517; C07D239/00; C07D401/00; C07D403/00; C07D405/00; C07D413/00; C07D417/00; C07D471/00; C07D521/00; (IPC1-7): A61K31/505; C07D401/12; C07D401/14; C07D405/12;

C07D413/14; C07D417/12

- european:

A61K31/517; C07D239/88; C07D239/94; C07D401/12; C07D401/14; C07D403/12; C07D403/14; C07D405/12; C07D405/14; C07D413/14; C07D417/12; C07D417/14; C07D471/04; C07D521/00B1E2A; C07D521/00B1E3A

Application number: WO2000GB00373 20000208
Priority number(s): EP19990400305 19990210

Also published as:

US7074800 (B1)
US2006004017 (A1
MXPA01008182 (A)
EE200100409 (A)
CN1597667 (A)

more >>

Cited documents:

WO9629301 WO9515758 EP0602851 WO9742187 WO9910349 more >>

Report a data error he

### Abstract of WO0047212

The invention relates to the use of compounds of formula (I), wherein ring C is an 8, 9, 10, 12 or 13membered bicyclic or tricyclic moiety which optionally may contain 1-3 heteroatoms selected independently from O, N and S; Z is -O-, -NH-, -S-, -CH2- or a direct bond; n is 0-5; m is 0-3; R<2> represents hydrogen, hydroxy, halogeno, cyano, nitro, trifluoromethyl, C1-3alkyl, C1-3alkoxy, C1-3alkylsulphanyl, -NR<3>R<4> (wherein R<3> and R<4>, which may be the same or different, each represents hydrogen or C1-3alkyl), or R<5>X<1>- (wherein X<1> and R<5> are as defined herein; R<1> represents hydrogen, oxo, halogeno, hydroxy, C1-4alkoxy, C1-4alkyl, C1-4alkoxymethyl, C1-4alkanoyl, C1-4haloalkyl, cyano, amino, C2-5alkenyl, C2-5alkynyl, C1-3alkanoyloxy, nitro, C1-4alkanoylamino, C1-4alkoxycarbonyl, C1-4alkylsulphanyl, C1-4alkylsulphinyl, C1-4alkylsulphonyl, carbamoyl, <u>N</u>-C1-4alkylcarbamoyl, <u>N</u>,<u>N</u>-di(C1-4alkyl)carbamoyl, aminosulphonyl, <u>N</u>-C1-4alkylaminosulphonyl, <u>N</u>,<u>N</u>-di(C1-4alkyl)aminosulphonyl, <u>N</u>-(C1-4alkylsulphony amino, <u>N</u>-(C1-4alkylsulphonyl)-<u>N</u>-(C1-4alkyl)amino, <u>N</u>,<u>N</u>-di(C1-4alkylsulphonyl)amino, a C3-7alkylene chain joined to two ring C carbon atoms, C1-4alkanoylaminoC1-4alkyl, carboxy or a group R<56>X<10> (wherein X<10> and R<56> are as defined herein); and salts thereof, in the manufacture of a medicament for use in the production of an antiangiogenic and/or vascular permeability reducing effect in warm-blooded animals, processes for the preparation of such compounds, pharmaceutical compositions containing a compound of formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt thereof as active ingredient and compounds of formula (I). The compounds of formula (I) and the pharmaceutically acceptable salts thereof inhibit the effects of VEGF, a property of value in the treatment of a number of disease states including cancer and rheumatoid arthritis.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

#### (19) 日本国特許庁 (JP)

## (12) 公表特許公報(A)

(11)特許出願公表番号 特表2002-536414 (P2002-536414A)

(43)公表日 平成14年10月29日(2002,10.29)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>		識別記号		FΙ			<b>デ</b> ー	マコード(参考)
C07D	239/88			C07D2	39/88			4 C 0 6 3
A 6 1 K	31/517		,	A 6 1 K	31/517			4 C 0 8 6
	31/5377	,			31/5377			
	31/541				31/541			
A 6 1 P	3/10		•	A61P	3/10			
			審査請求有	予備	審査請求	有	(全520頁)	最終頁に続く

(21)出願番号 特願2000-598164(P2000-598164) (71)出願人 アストラゼネカ アクチボラグ (86) (22)出顧日 平成12年2月8日(2000.2.8) スウェーデン国 151 85 セーデルテル (85)翻訳文提出日 平成13年8月10日(2001.8.10) イェ(無番地) (86)国際出願番号 PCT/GB00/00373 (72)発明者 エネカン、ローラン・フランソワ・アンド (87)国際公開番号 WO00/47212 (87)国際公開日 平成12年8月17日(2000.8.17) フランス共和国エフー51689 ラーンスー (31)優先権主張番号 99400305.1 セデックス 2, ポワット・ポスタル (32)優先日 平成11年2月10日(1999.2.10) 1050, ゼッド・イ・ラ・ポンペーユ (33)優先権主張国 欧州特許庁(EP) (72)発明者 プレ,パトリック フランス共和国エフ-51689 ラーンス-セデックス 2、ボワット・ポスタル 1050, ゼッド・イ・ラ・ポンペーユ

(54) 【発明の名称】 血管形成阻害剤としてのキナゾリン誘導体

#### (57) 【要約】

本発明は、式Iの化合物[式中、環Cは、O、N及びS から独立して選択される1~3個のヘテロ原子を場合に より含有し得る8、9、10、12又は13員の二環式 又は三環式部分であり:2は一〇一、一NH一、一S -、-CH₂-又は直接の結合であり;nは0~5の整 数であり;mは $0\sim3$ の整数であり;R $^{2}$ は水素、ヒド ロキシ、ハロゲノ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチ ル、C1-3アルキル、C1-3アルコキシ、C1-3アルキル スルファニル、-NR3R1(ここで、R3及びR1は同じ であっても異なっていてもよく、それぞれ水素又はC 1-3 アルキルを表す)、又はR<sup>5</sup> X<sup>1</sup> - を表し(ここで、 X¹及びR⁵は本明細書に定義される通りである); R¹ は水素、オキソ、ハロゲノ、ヒドロキシ、C1-4アルコ キシ、C1-4アルキル、C1-4アルコキシメチル、C1-4 アルカノイル、C1-4ハロアルキル、シアノ、アミノ、 C2-5 アルケニル、C2-6 アルキニル、C1-3 アルカノイ ルオキシ、ニトロ、C1-4アルカノイルアミノ、C1-4ア ルコキシカルポニル、C1-4アルキルスルファニル、C ι-ィアルキルスルフィニル、C1-4アルキルスルホニル、

カルバモイル、N-C1-4アルキルカルバモイル、N, N-ジ (C1-4 アルキル) カルバモイル、アミノスルホ ニル、N – Cı-ィアルキルアミノスルホニル、N,N – ジ(C1-4アルキル)アミノスルホニル、N-(C1-4ア ルキルスルホニル) アミノ、N-(C1-4アルキルスル ホニル) -N- (C1-4アルキル) アミノ、N, N-ジ (C1-4アルキルスルホニル) アミノ、環Cの2つの炭 素原子に結合したC<sub>8-7</sub>アルキレン鎖、C<sub>1-4</sub>アルカノイ ルアミノC1-4アルキル、カルポキシ、又はR56 X10を 表す(ここで、X10及びR56は本明細書に定義される通 りである)]、及びその塩の、温血動物において抗血管 形成効果及び/又は血管透過性抑制効果を生ずるのに使 用する医薬品の製造における使用、そのような化合物の 製造法、式(I)の化合物又はその製剤的に許容される 塩を有効成分として含有する医薬組成物、及び式(I) の化合物群に関する。式(Ⅰ)の化合物及びその製剤的 に許容される塩はVEGFの作用を阻害し、これは癌及 び慢性関節リウマチを含む数多くの病態の治療において 有用な特性である。

(74)代理人 弁理士 社本 一夫 (外5名)

最終頁に続く